

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



BEST AVAILABLE COPY

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
6. Januar 2005 (06.01.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/000263 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: A61K 9/00 (84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/006659

(22) Internationales Anmeldedatum:
19. Juni 2004 (19.06.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 28 942.9 27. Juni 2003 (27.06.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): LTS LOHMANN THERAPIE-SYSTEME AG [DE/DE]; Lohmannstrasse 2, 56626 Andernach (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): RADEMACHER, Tina [DE/DE]; Eifelstrasse 34, 53498 Bad Breisig (DE). VON FALKENHAUSEN, Christian [DE/DE]; Merler Ring 7, 53340 Meckenheim (DE).

(74) Anwalt: FLACCUS, Rolf-Dieter; Bussardweg 10, 50389 Wesseling (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO Patent (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

— Erfindererklärung (Regel 4.17 Ziffer iv) nur für US

— Erfindererklärung (Regel 4.17 Ziffer iv) nur für US

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

— vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: TRANSMUCOSAL FORM OF ADMINISTRATION WITH REDUCED MUCOSAL IRRITATION

(54) Bezeichnung: TRANSMUKOSALE DARREICHUNGSFORM MIT VREMINDERTER SCHLEIMHAUTIRRITATION

(57) **Abstract:** The invention relates to film-type forms of administration for the transmucosal administration of active ingredients to the human or animal body. Said forms of administration are characterised by an adaptation or approach of the pH value of the base mass used to produce the form of administration and comprising a solvent or a solvent mixture, at least one matrix-forming polymer and at least one active ingredient, to the physiological pH value of the mucosa for the application. The invention also relates to a method for producing such preparations and to the use of the same as forms of administration, especially for pharmaceutical active ingredients, in such a way that mucosal irritation is reduced or even prevented by the application of the resulting forms of administration.

(57) **Zusammenfassung:** Die vorliegende Erfindung betrifft filmförmige Darreichungsformen zur transmukosalen Verabreichung von Wirkstoffen an den menschlichen oder tierischen Körper, die durch eine Anpassung oder Annäherung des pH-Wertes der für die Herstellung der Darreichungsform vorgesehenen Basismasse, umfassend ein Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch, mindestens ein matrixbildendes Polymer und mindestens einen Wirkstoff, an den physiologischen pH-Wert der für die Applikation vorgesehenen Schleimhaut gekennzeichnet sind, ein Verfahren für die Herstellung solcher Zubereitungen und deren Verwendung als Darreichungsform, insbesondere für pharmazeutische Wirkstoffe, so dass bei Anwendung der resultierenden Darreichungsform eine Irritation der Schleimhaut verringert oder gar verhindert wird.

WO 2005/000263 A1